



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

268 836

(11)

(13) 32

(51) Int. Cl.⁴
A 01 N 33/04

(21) PV 6423-87.P
(22) Přihlášeno 03 09 87
(30) Právo přednosti 05 09 86
(P 36 30 344.5) DE

(40) Zveřejněno 14 08 89
(45) Vydáno 08 02 91

(72) Autor vynálezu

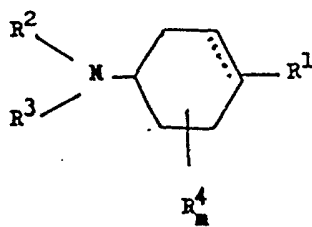
(73) Majitel patentu

SAUTER HUBERT dr., MANNHEIM
ZIPLIES MATTHIAS dr., HIRSCHBERG
GOETZ NORBERT dr., WORMS
AMMERMAN EBERHARD dr., LUDWIGSHAFEN
POMMER ERNST-HEINRICH dr., LIMBURGERHOF (DE)
BASF AKTIENGESELLSCHAFT, LUDWIGSHAFEN (DE)

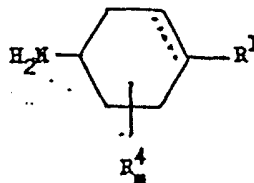
(54)

Fungicidní prostředek a způsob výroby
účinných látek

(57) Fungicidní prostředek, který jako účinnou složku obsahuje alespoň jeden 4-substituovaný derivát cyklohexylaminu vzorce I, ve kterém R^1 znamená skupinu $CR^5R^6R^7$, kde R^5 , R^6 , a R^7 jsou stejné nebo různé a znamenají vodík, popřípadě hydroxyskupinou substituovaný C_1 -8-alkyl, C_1 -8-alkoxy, C_1 -6-alkylthio nebo C_3 -6-cykloalkyl s tím, že nejvýše jeden ze substituentů R^5 , R^6 nebo R^7 smí představovat vodík, nebo R^5 má shora uvedený význam a R^6 a R^7 společně s atomem uhlíku, který je mezi nimi, tvoří 3- až 6-členný karbocyklický alifatický kruh, R^2 a R^3 jsou stejné nebo různé a znamenají vodík, C_1 -20-alkyl, C_2 -4-alkenyl nebo C_3 -4-alkinyl nebo C_3 -12-cykloalkyl nebo C_5 -8-cykloalkenyl, přičemž tyto zbytky jsou popřípadě substituovány, s tím, že součet atomů uhlíku a heteroatomů zbytků R^2 a R^3 činí nejméně 8, R^4 znamená stejné nebo rozdílné substituenty zvolené ze skupiny tvořené vodíkem, C_1 -8-alkylem, C_3 -6-cykloalkylem nebo C_1 -8-alkoxy a $m = 1$ až 4. Přídavná tečkovaná vazba znamená, že v tomto místě může být přítomna jednoduchá nebo dvojná vazba, nebo jeho sůl. Sloučeniny vzorce I se připravují alkylací odpovídajících primárních aminů obecného vzorce II působením alkylačních činidel zavádějících zbytky R^2 a R^3 .



(I)



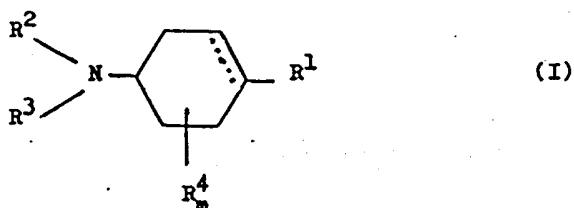
(II)

Vynález se týká fungicidního prostředku, který obsahuje jako účinnou složku nové deriváty 4-substituovaného cyklohex(en)yleminu. Dále se vynález týká způsobu výroby těchto nových 4-substituovaných derivátů cyklohex(en)ylaminu, jakož i jejich použití jako fungicidů k potírání škodlivých hub.

Je již znám 4-trans-terc.butyl-N-benzylcyklohexylamin (srov. J. Org. Chem. 48, 3412 (1983)), avšak tato sloučenina nemá fungicidní účinek, který by stál za pozornost.

Nyní bylo zjištěno, že určité deriváty cyklohexylaminu mají silný fungicidní účinek při dobré snášenlivosti rostlinami.

Předmětem předloženého vynálezu je tudíž fungicidní prostředek, který se vyznačuje tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jeden 4-trans-substituovaný cyklohexylamin nebo derivát této sloučeniny obecného vzorce I



ve kterém

R^1

znamená skupinu $CR^5R^6R^7$,

kde

R^5 , R^6 a R^7 jsou stejné nebo rozdílné a znamenají atom vodíku, rozvětvenou nebo nerozvětvenou, popřípadě hydroxyskupinu substituovanou alkylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku s tím, že nejvýše jeden ze substituentů R^5 , R^6 nebo R^7 smí znamenat vodík, nebo kde R^5 má některý ze shora uvedených významů a R^6 a R^7 společně s atomem uhlíku, který je mezi nimi, tvoří tří- až šestičlenný karbocyklický alifatický kruh,

R^2 a R^3

jsou stejné nebo rozdílné a znamenají atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 20 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku nebo alkinylovou skupinu se 3 až 4 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 12 atomy uhlíku nebo cykloalkenylovou skupinu s 5 až 8 atomy uhlíku, které samy mohou být opět substituovány hydroxyskupinou, alkoxyskupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, alkylthioskupinou s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, alkenylovou skupinou se 2 až 4 atomy uhlíku, alkinylovou skupinou se 3 až 4 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinou se 3 až 12 atomy uhlíku nebo fenylovou skupinou, naftylovou skupinou, feno-

xyskupinou nebo naftoxyskupinou, které samy jsou popřípadě substituovány alkylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, alkenylovou skupinou se 2 až 4 atomy uhlíku, alkylovou skupinou se 3 až 4 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinou se 3 až 6 atomy uhlíku nebo cykloalkenylovou skupinou s 5 až 8 atomy uhlíku, alkoxyskupinou se 2 až 8 atomy uhlíku, atomem halogenu nebo trifluormethylou skupinou, s tím, že součet atomů uhlíku a heteroatomů (tj. kyslíku, síry a atomů halogenu) u substituentů R^2 a R^3 činí společně alespoň 8,

R^4 znamená stejné nebo rozdílné substituenty v libovolném stérickém uspořádání zvolené ze skupiny, která je tvořena atomem vodíku, alkylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinou se 3 až 8 atomy uhlíku nebo alkoxyskupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, a

m znamená čísla 1 až 4,

nebo soli těchto sloučenin.

Vazba $****$ může být přítomna jako dvojná vazba (4-substitovaný cyklohexenylamin) nebo jako jednoduchá vazba (4-trans-substituovaný cyklohexylamin).

Jako účinné látky přicházejí z praktických důvodů v úvahu také soli aminů obecného vzorce I.

Solemi se rozumí soli aminů s libovolnými anorganickými a organickými kyselinami, například s chlorovodíkovou kyselinou, octovou kyselinou, sírovou kyselinou, dodecylbenzen-sulfonovou kyselinou, palmitovou kyselinou.

Substituent R^1 znamená například alkylovou skupinu se 3 až 8 atomy uhlíku, isopropylou skupinu, n-but-2-ylovou skupinu, terc.butylovou skupinu, n-pent-ylovou skupinu, n-pent-3-ylovou skupinu, 2-methylbut-2-ylovou skupinu, 3-methylbut-2-ylovou skupinu, n-hex-2-ylovou skupinu, n-hex-3-ylovou skupinu, 1,1-dimethylbutylovou skupinu, n-butylovou skupinu, heptylovou skupinu, 2-methylhex-2-ylovou skupinu, n-oktylovou skupinu, 1,1,3,3-tetramethylbutylovou skupinu, 1-methoxyethylou skupinu, 1-ethoxyethylou skupinu, 2-methoxyprop-2-ylovou skupinu, 2-ethoxyprop-2-ylovou skupinu, 1-cyklopropylethylovou skupinu, 1-cyklobutylethylovou skupinu, 1-cyklohexylethylovou skupinu, 2-cyklopropylprop-2-ylovou skupinu, 2-cyklobutylprop-2-ylovou skupinu, 2-cyklopentylprop-2-ylovou skupinu, 2-cyklohexylprop-2-ylovou skupinu, cyklohexen-1-ylovou skupinu, cyklopropylovou skupinu, cyklobutylovou skupinu, cyklopentylovou skupinu, cyklohexylovou skupinu, cykloheptylovou skupinu, 1-methylcyklohex-1-ylovou skupinu, 1-ethylcyklohex-1-ylovou skupinu, 4-(4-terc.butylcyklohexyl)-cyklohexylovou skupinu.

R^2 a R^3 znamenají nezávisle na sobě například atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 18 atomy uhlíku, metylovou skupinu, ethylovou skupinu, propylovou skupinu, isopropylovou skupinu, n-butylovou skupinu, isobutylovou skupinu, n-pentylovou skupinu, 3-methylbut-2-ylovou skupinu, isopentylovou skupinu, n-hexylovou skupinu, n-heptylovou skupinu, 4,4-dimethylpentylovou skupinu, n-oktylovou skupinu, 6,6-dimethylhept-2-ylovou skupinu, n-nonylovou skupinu, 3,5,5-trimethylhexylovou skupinu, n-decylovou skupinu, 3,7-dimethylokt-2-ylovou skupinu, n-undecylovou skupinu, n-dodecylovou skupinu, n-eikosylovou skupinu, allylovou skupinu, propargylovou skupinu, cyklopropylovou skupinu, cyklohexylovou skupinu, 4-terc.butylcyklohexylmetylovou skupinu, 4-neopen-tylcyklohexylmetylovou skupinu, 4-(+,1,3,3-tetramethylbutyl) cyklohexylmetylovou skupinu, alkylbenzylovou skupinu, 4-me-

thylbenzylovou skupinu, 4-isopropylbenzylovou skupinu, 4-terc.butylbenzylovou skupinu, 4-neopentylbenzylovou skupinu, 4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)benzylovou skupinu, trifluormethylbenzylovou skupinu, 4-trifluormethylbenzylovou skupinu, halogenbenzylovou skupinu, 4-chlorbenzylovou skupinu, 2,4-dichlorbenzylovou skupinu, 4-methoxybenzylovou skupinu, 4-terc.butoxybenzylovou skupinu, 2-chlor-4-fenylbenzylovou skupinu, α -naftylmethyllovou skupinu, β -naftylmethyllovou skupinu, 3-(4-terc.butylfenyl)-2-methylpropylovou skupinu.

R^4 znamená například atom vodíku, methyllovou skupinu, ethylovou skupinu, n-propylovou skupinu, methoxyskupinu, ethoxyskupinu nebo cyklohexylovou skupinu.

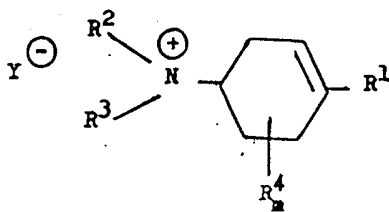
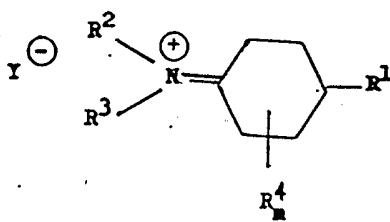
Index m znamená například čísla 1, 2, 3 nebo 4.

Jak již bylo uvedeno, mohou se sloučeniny obecného vzorce I používat jako fungicidy, zejména při potírání škodlivých hub.

Ze sloučenin obecného vzorce I jsou výhodné 4-trans-substituované deriváty cyklohexylaminu.

Předmětem předloženého vynálezu je rovněž způsob výroby 4-substituovaných cyklohex(en)ylaminů obecného vzorce I.

Nové 4-substituované cyklohex(en)ylaminy obecného vzorce I se mohou připravovat tím, že se odpovídající iminová, popřípadě imoniová sůl obecného vzorce



ve kterých Y^- znamená libovolný aniont, stereoselektivně redukuje komplexním hydridem v přítomnosti ředidla za vzniku sloučeniny vzorce I.

Cyklohexylominy, popřípadě iminiové soli, které jsou potřebné jako výchozí látky pro tento postup, se dají vyrábět známými metodami z 4-alkyl-substituovaných cyklohexanonů a aminů.

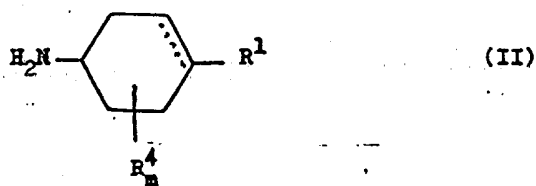
(Srov. Methoden der Org. Chemie (Hoube-Weyl), sv. VIII. str. 1945 a další, 4. vydání. G. Thieme Verlag, Stuttgart 1952;

Methoden der Org. Chemie (Houben-Weyl), sv. XI/2, str. 77 a další, 4. vydání, 3. Thieme Verlag, Stuttgart 1958;

Methoden der Org. Chemie (Houben-Weyl), sv. VII 2b, str. 1948 a další, 4. vydání. G. Thieme Verlag, Stuttgart 1976).

Jako redukční činidla se při provádění uvedeného postupu používají komplexní hydridy, výhodně natriumborhydrid, natriumcyanborhydrid, lithiualuminiumhydrid, lithium-terc.butoxyaluminium-hydrid, lithium-tri-(2-methylbut-2-yl)borhydrid a jako ředidla se používají výhodně aprotická rozpouštědla jako diethylether, tetrahydrofuran, dioxan, ethylenglykoldimethyl- a -diethylether.

Podle tohoto vynálezu se sloučeniny obecného vzorce I připravují z odpovídajících primárních amidů obecného vzorce II

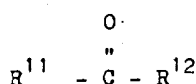


ve kterém

R^1 , R^4 a m mají shora uvedený význam, alkyací pomocí alkylačních činidel zavádějících zbytky R^2 a R^3 shora uvedeného významu.

II	alkylace	II	alkylace	I
$(R^2 = H)$		$(R^2 = H)$		
$(R^3 = H)$		$(R^3 = H)$		

Jako alkylační činidla jsou pro postup podle vynálezu vhodné například odpovídající sloučeniny typu R^2-X , popřípadě R^3-X , přičemž X znamená odštěpitelnou skupinu přitahující elektrony. Místo sloučenin shora uvedeného typu je možno v mnoha případech používat také aldehydy nebo ketony, přičemž ty pak odpovídají obecným vzorcům



ve kterých

R^{11} a R^{12} odpovídají zbytkům R^2 , popřípadě R^3 , s tím, že obsahují o jeden atom uhlíku méně, než R^2 a R^3 .

Aldehydy, popřípadě ketony se uvádějí v reakci v přítomnosti redukčního činidla a popřípadě v přítomnosti katalyzátoru, jakož i popřípadě v přítomnosti rozpouštědla s příslušnými primárními, popřípadě sekundárními aminy.

Primární cyklohexylaminy, popřípadě cyklohexenylaminy, které jsou při postupu podle vynálezu potřebné jako výchozí látky pro výrobu sloučenin obecného vzorce I, jsou buď známými sloučeninami, nebo se mohou vyrábět například katalytickou hydrogenací odpovídajících 4-alkyl-substituovaných nitroaromátů nebo anilinů, popřípadě reduktivní aminací 4-alkyl-substituovaných fenolů.

(Srov.: Methoden der Org. Chemie (Houben-Weyl), sv. 5(1a, 4. vydání, G.Thieme Verlag, Stuttgart 1970;

Methoden der Org. Chemie (Houben-Weyl), sv. 4/1c, 4. vydání, G. Thieme Verlag, Stuttgart 1980;

Methoden der Org. Chemie (Houben-Weyl), sv. 11/1, str. 103 a další, 4.vydání, G. Thieme Verlag, Stuttgart 1957).

Přitom se získají směsi stereoisomerů, které se mohou dělit známým způsobem, například destilací.

Sloučeniny obecných vzorců R^2X a R^3X , ve kterých X znamená chlor, brom a jod nebo znamená popřípadě substituovanou alkylsulfonyloxyskupinu nebo arylsulfonyloxyskupinu, zejména methansulfonyloxyskupinu, trifluormethansulfonyloxyskupinu nebo p-toluen-sulfonyloxyskupinu, které jsou potřebné jako výchozí látky, jsou známými a na trhu obvyklými sloučeninami nebo se mohou vyrábět z odpovídajících alkoholů známým způsobem.

Jako ředidla pro provádění alkylace přicházejí v úvahu jak protická tak i eprotická rozpouštědla.

K těm náleží zejména alkoholy, jako methanol, ethanol, propanol, butanol, amylalkohol, alifatické nebo aromatické, popřípadě halogenované uhlovodíky, jako například benzin, benzen, toluen, xylén, chlorbenzen, petrolether, hexan, cyklohexan, dichlormethan- chloroform, tetrachlormethan, étery, jako diethylether, dioxen, tetrahydrofuran nebo ethylenglykoldimethyl- nebo diethylether, ketony, jako aceton nebo butanon, nitrily, jako acetonitril nebo propionitril, amidy, jako dimethylformamid, dimethylacetamid, N-methylformanilid, N-methylpyrrolidon nebo hexamethyltramid fosforečné kyseliny, estery, jako ethylacetát nebo sulfoxidy, jako dimethylsulfoxid. Může se však pracovat také bez ředidel.

Tento postup probíhá v přítomnosti činidla vázajícího kyselinu, tedy anorganické nebo organické báze. Pro tyto účely přichází v úvahu například hydroxidy alkalických kovů, jako hydroxid sodný nebo hydroxid draselný; uhličitany alkalických kovů, jako uhličitán sodný, jakož i terciární aminy, jako triethylamin, N,N-dimethylanilin, pyridin, N,N-dimethylaminopyridin, diazabicykloundecan.

Jako činidlo vázající kyselinu může sloužit rovněž odpovídající nadbytek aminu používaného pro reakci, a pokud je amin kapalnou látkou, může sloužit také jako ředidlo.

Reakční podmínky pro takovéto alkylační reakce jsou známy.

To platí také tehdy, když se při provádění postupu používá jako výchozích látek aldehydů nebo ketonů. Také tyto sloučeniny jsou známými sloučeninami a jsou na trhu běžně k dispozici.

Dělení isomerů cis/trans-4-terc.butylcyklohexylaminu

Z 1,5 litru 4-terc.butylcyklohexylaminu (směs isomerů; trans : cis = 8 : 2) se při atmosférickém tlaku přes pozrcadlenou 100 cm kolonu pozvolna oddestiluje asi 860 g směsi isomerů (asi 10 až 20 kapek/min; teplota varu 205 až 208°C). Ke zbytku v destilační koloně se přidá 10 g práškového hydroxidu sodného a směs se dvakrát destiluje přes destilační nástavec (82°C / 1100 Pa). Získá se 485 g trans-4-terc.butylcyklohexylaminu (95 % trans-isomeru podle plynové chromatografie a analýzy NMR spektrm), který se může používat pro mnohé z dále popsanych sloučenin.

Příklady ilustrující způsob výroby účinných látek

P ř í k l a d 1

Trans-N-(4-terc.butylbenzyl)-4-terc.butylcyklohexylamin

K roztoku 15,5 g (0,1 mol) trans-4-terc.butylcyklohexylaminu ve 100 ml absolutního methanolu se přikape za chlazení ledem 15 ml 6,5 N methanolického chlorovodíku. Poté se k reakční směsi přidá 22 g molekulového síta (3×10^{-10} m), 16,2 g (0,1 mol) 4-terc.butylbenzaldehydu a po částech 3,1 g (50 mmol) natriumkyanborhydridu a směs se míchá 22 hodin při teplotě místnosti. Potom se směs okyslí koncentrovanou chlorovodíkovou kyselinou na pH 0 až 1 a zahustí se za sníženého tlaku. Vyloučená pevná látka se odfiltruje, promyje se methylterc.butyletherem a 20% roztokem hydroxidu sodného a znovu methylterc.butyletherem. Směs se extrahuje methylterc.butyletherem. Spojené organické extrakty se promyjí vodou, vysuší se síranem hořečnatým a zahustí se za sníženého tlaku. Získaný zbytek se nechá vykristalovat z hexanu při teplotě -28°C. Získá se 15 g sloučeniny uvedené v názvu (50% teorie).

P ř í k l a d 2

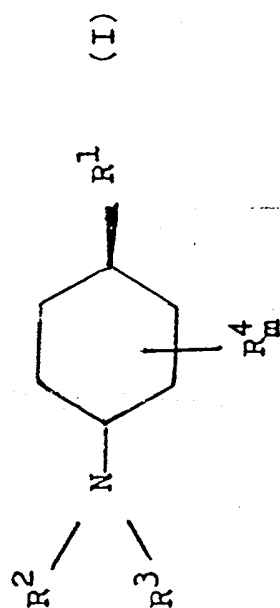
Trans-N-n-oktyl-4-terc.butylcyklohexylamin

26,1 g (0,17 mol) trans-4-terc.butylcyklohexylaminu, 7,7 g (0,056 mol) uhličitanu draselného, 4,6 g (0,028 mol) jodidu draselného a 10,8 g (0,056 mol) n-oktylbromidu se zahřívá ve 100 ml acetonitrilu 5 hodin k varu pod zpětným chladičem. Potom se směs zahustí za sníženého tlaku, a zbytek se vyjme dichlormethanem a zředěným hydroxidem sodným. Organický extrakt se promyje, vysuší se síranem sodným a zahustí se za sníženého tlaku. Získaný olej se destiluje za sníženého tlaku. Získá se 12,4 g (83% teorie) sloučeniny uvedené v názvu (teplota varu 120°C/10 Pa).

Odpovídajícím způsobem se vyrobí trans-4-substituované cyklohexylaminy uvedené v následující tabulce 1, jakož i 4-substituované cyklohexen-3-ylaminy uvedené v tabulce 2, pokud jsou uvedeny jejich vlastnosti (fyzikální data, popřípadě fyzikální skupenství). Látky, které jsou uvedeny bez těchto údajů se mohou vyrobit odpovídajícím způsobem z příslušných výchozích látek.

T a b u l k a 1

Sloučeniny vzorce I



slouče- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
3	terc.butyl	n-butyl	n-butyl	H	olej
4	terc.butyl	n-butyl	2-methylethyl	H	olej
5	terc.butyl	n-butyl	1,2-dimethylpropyl	H	olej

slouče-
nina č.

	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
6	terc.butyl	n-butyl	4-methylbutyl	H	olej
7	terc.butyl	n-butyl	1,3-dimethylbutyl	H	olej
8	terc.butyl	4,4-dimethylpentyl	methyl	H	olej
9	terc.butyl	4,4-dimethylpentyl	n-butyl	H	olej
10	terc.butyl	1,5-dimethylhexyl	H	H	olej
11	terc.butyl	1,5-dimethylhexyl	methyl	H	olej
14	terc.butyl	1,5-dimethylhexyl	n-butyl	H	olej
15	terc.butyl	3,5,5-trimethylhexyl	H	H	olej
16	terc.butyl	3,5,5-trimethylhexyl	methyl	H	

CS 263 816 32

slouče- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
19	terc.butyl	3,5,5-trimethylhexyl	n-butyl	H	olej
20	terc.butyl	1,2,6-trimethylheptyl	H	H	olej
21	terc.butyl	1,2,6-trimethylheptyl	methyl	H	
24	terc.butyl	1,2,6-trimethylheptyl	n-butyl	H	olej
28	terc.butyl	n-oktyl	n-butyl	H	olej
29	terc.butyl	3,7-dimethyloktyl	H	H	olej
30	terc.butyl	3,7-dimethyloktyl	methyl	H	olej
31	terc.butyl	3,7-dimethyloktyl	ethyl	H	olej
33	terc.butyl	3,7-dimethyloktyl	n-butyl	H	olej

33 336 336 336 336

33

slouče- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
34	terc.butyl	n-decyl	H	H	olej
39	terc.butyl	1,5,9-trimethyldecyl	H	H	olej
43	terc.butyl	1,5,9-trimethyldecyl	n-butyl	H	olej
44	terc.butyl	4-terc.butylbenzyl	methyl	H	t.t. 56 - 58 °C
45	terc.butyl	4-terc.butylbenzyl	ethyl	H	olej
47	terc.butyl	4-terc.butylbenzyl	n-butyl	H	olej
49	terc.butyl	4-terc.butylbenzyl	1-methylethyl	H	olej
51	terc.butyl	4-terc.butylbenzyl	4-methylbutyl	H	
53	terc.butyl	4-terc.butylbenzyl	2-methoxyethyl	H	

sloučenina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
54	terc.butyl	3-(4-terc.butylfenyl)- -2-methylpropyl	H	H	t.t. 72 - 76 °C
55	terc.butyl	4-chlorbenzyl	H	H	t.t. 53 - 55 °C
56	terc.butyl	2,4-dichlorbenzyl	H	H	t.t. 68 - 71 °C
57	terc.butyl	2-fenoxyethyl	H	H	olej
58	terc.butyl	2-(2,4-dichlor- fenoxy)ethyl	H	H	t.t. 64 - 68 °C
59	terc.butyl	9-methylfluoren-9-yl	H	H	olej
60	terc.butyl	5-(4-methylfenyl)pentyl	H	H	t.v. 184 °C/40 Pa
61	terc.butyl	5-(4-methoxyfenyl)pentyl	H	H	t.v. 184 °C/10 Pa

slouče- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
62	terc.butyl	5-(4-isopropylfenyl)- pentyl	H	H	olej
63	terc.butyl	8-(4-methylpentyl)- oktyl	H	H	t.v. 215 °C/90 Pa
64	terc.butyl	5-(2,4-dimethylfenyl)- pentyl	H	H	t.v. 159 °C/10 Pa
71	isopropyl	5-(4-methylfenyl)- pentyl	H	H	t.v. 166 °C/10 Pa
73	1,1,3,3-tetra- methylbutyl	4-terc.butylbenzyl	H	H	t. 150 - 152 °C
74	1,1,3,3-tetra- methylbutyl	4-terc.butylbenzyl	4-terc.butylbenzyl	H	t.t. 231 - 234 °C

slouže- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
76	terc.butyl	3-(2-naftyl)-2- -methylpropyl	H	H	t.v. 190 °C/30 Pa
79	terc.butyl	(trans-4-terc.butyl- cyklohexyl)methyl	H	H	t.t. 66 - 68 °C
81	terc.butyl	(cis-4-terc.butyl- cyklohexyl)methyl	H	H	t.t. 72 - 74 °C
83	terc.butyl	1-(4-terc.butylfenyl)- ethyl	H	H	t.t. 67 - 69 °C
84	terc.butyl	4-terc.amylbenzyl	H	H	olej
87	terc.butyl	4-terc.butoxybenzyl	H	H	t.v. 160 °C/30 Pa

slouče- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
90	terc.butyl	4-butoxybenzyl	H	H	t.v. 172 °C/20 Pa
104	terc.butyl	4-butoxybenzyl	-CH ₃	H	t.t. 46 - 48 °C
191	cyklohexyl	4-terc.butylbenzyl	H	H	t.t. 68 - 70 °C
196	terc.butyl	H	2-methyl-4-terc.- butylbenzyl	H	t.t. 54 - 58 °C
204	terc.butyl	H	4-(1-methoxy-1- methylethyl)benzyl	H	t.t. 47 - 49 °C
220	terc.butyl	2-(4-terc.butyl- fenyl)ethyl	H	H	olej
222	isopropyl	2-(4-terc.butyl- fenyl)ethyl	H	H	

slouče- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
254	terc.butyl	4-(2-propenyl)benzyl	H	H	olej
255	terc.butyl	4-(1-hydroxy-1,1- -dimethylethyl)benzyl	H	H	olej
256	terc.butyl	4-methoxy-3-terc.- butylbenzyl	H	H	t.t. 40 - 42 °C
257	terc.butyl	trans-4-terc.butyl- cyklohexyl	H	H	t.t. 70 - 72 °C
258	terc.butyl	cis-4-terc.butyl cyklohexyl	H	H	t.t. 46 - 48 °C
259	terc.butyl	2-(2-fluorfenoxi)- ethyl	H	H	olej
260	terc.butyl	2-(2-chlorfenyl)ethyl	H	H	olej

slouče- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
261	terc.butyl	2-(2,3-dichlorfenyl)- ethyl	H	H	olej
262	terc.butyl	2-(3-trifluormethyl- fenyl)ethyl	H	H	olej
263	terc.butyl	2-(3-terc.butyl- fenyl)ethyl	H	H	olej
264	terc.butyl	3-terc.butylbenzyl	H	H	olej
265	1,1,3,3-tetra- methylbutyl	1-butyl	1-butyl	H	t.v. 150 °C/50 Pa
266	(1-cyklohexyl- -1-methyl)ethyl	4-terc.butylbenzyl	H	H	t.v. 208-212 °C/40 Pa

66 263 265 266 32

slouče- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
267	terc.butyl	1-naftylmethyl	H	H	t.v. 175 °C/20 Pa
268	terc.butyl	4-trifluormethyl- benzyl	H	H	t.v. 127 °C/20 Pa
269	terc.butyl	2-brombenzyl	H	H	t.v. 146 °C/20 Pa
270	terc.butyl	cyklopropyl	H	H	olej
271	terc.butyl	4-terc.butylbenzyl	cyklopropyl	H	olej
272	terc.butyl	2-naftylmethyl	H	H	olej
273	terc.butyl	3-brombenzyl	H	H	t.v. 175 °C/90 Pa
274	terc.butyl	4-brombenzyl	H	H	t.v. 160 °C/50 Pa

slouče- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
275	terc.butyl	3-(2-chlorfenyl)- -2-fenyl-2-propenyl	H	H	olej
276	terc.butyl	2-brombenzyl	methyl	H	olej
277	terc.butyl	2-trifluormethylbenzyl	H	H	t.v. 138 °C/80 Pa
278	terc.butyl	3-brombenzyl	methyl	H	olej
279	terc.butyl	4-brombenzyl	methyl	H	olej
280	terc.butyl	n-dodecyl	H	H	t.v. 156 °C/20 Pa
281	terc.butyl	pentafluorbenzyl	H	H	t.v. 115 °C/20 Pa
282	terc.butyl	2,4,6-trimethylbenzyl	H	H	t.v. 178 °C/20 Pa

CS 262 263 264 265 266 267 268 269 270 271 272 273 274 275 276 277 278 279 280 281 282

slouče- nina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	fyzikální data
283	terc.butyl	4-n-dodecylbenzyl	H	H	olej
284	terc.butyl	1-(4-chlorfenyl)- cyklohexyl-1-methyl	H	H	pryskyřice
285	terc.butyl	1-(4-chlorfenyl)- cyklohexyl-1-methyl	methyl	H	olej
286	terc.butyl	4-terc.butylbenzyl	propargyl	H	olej
287	terc.butyl	5-(3,4-dimethyl- fenyl)pentyl	H	H	t.v. 159 °C/40 Pa

CS 266 836 B2

Příklady ilustrující biologickou účinnost

Při dále popisovaných testech bylo jako srovnávací účinné látky (standardu) používáno N-benzyl-trans-4-terc.butylcyklohexylaminu, který je znám z J. Org. Chem. 48,3412 (1983) [srovnávací účinná látka A].

P ř í k l a d 1

Účinek proti padlí travnímu (*Erysiphe graminis* var. *tritici*) na pšenici

Listy klíčících rostlin pšenice druhu "Frühgold", které rostou v květináčích, se postříkají vodnými postřikovými suspenzemi, obsahujícími v sušině 80 % hmotnostních účinné látky a 20 % hmotnostních emulgátoru. 24 hodin po oschnutí postřikové vrstvy se popráší oidie (spóry) padlí *Erysiphe graminis* var. *tritici*. Pokusné rostliny se potom umístí do skleníku, kde se udržují při teplotě mezi 20 až 22°C a při 75 až 80% relativní vlhkosti vzduchu. Po 7 dnech se zjistí stupeň vývoje padlí.

Výsledky pokusu se hodnotí podle následující stupnice:

- 0 = žádné napadení houbou,
odstupňováno až do
- 5 = úplné napadení houbou;
- A = mírné poškození listů,
- B = střední poškození listů,
- C = silné poškození listů a
- T = úplné poškození listů,

účinná látka č.	napadení listů po ošetření 0,025% přípravkem účinné látky
1	1
2	2A
15	2
16	2A
28	2
30	2
33	2
44	1
47	2
53	2
54	2
60	2A
61	2
62	2
64	2
79	2
81	1
83	2A
84	1A
87	1
90	2
191	2

účinná látka č.	napadení listů po ošetření 0,025% přípravkem účinné látky
196	1A
204	1A
220	1
254	1
268	0A
271	1A
274	2A
279	0A
280	2
282	2
286	1
287	2
srovnávací prostředek A	3-4B
neošetřeno	5

P ř í k l a d 2

Účinek proti padlí okurek padlí okurek (Erysiphe cichoracearum)

Listy klíčnic rostlin okurek druhu "Chinesische Schlange", které rostou v květináčích, se ve stádiu dvou listů postříkají vodnou suspenzí konidií padlí Erysiphe cichoracearum. Po 1 dni se tyto pokusné rostliny postříkají až do stadia odkapávání kapek vodnými postříkovými suspenzemi, obsahujícími v sušině 80% hmotnostních účinné látky a 20% hmotnostních emulgátoru, načež se umístí do skleníku, kde se udržují při teplotách mezi 20 až 22°C a při 70 až 80% relativní vlhkosti vzduchu. 21 dnů po inokulaci se zjistí stupeň napadení padlím.

Výsledky pokusu se hodnotí podle následující stupnice:

- 0 = žádné napadení houbou,
odstupňováno až do
- 5 = úplné napadení houbou;
- A = mírné poškození listů;
- B = střední poškození listů;
- C = silné poškození listů a
- T = úplné poškození listů.

účinná látka č.	napadení listů po ošetření 0,025% vodným přípravkem účinné látky
1	0A
2	2B
20	2A
29	0B
30	2
44	0B
47	1A
51	1A

účinná látka č.	napadení listů po ošetření 0,025% vodným přípravkem účinné látky
55	1A
56	1
57	0B
73	1
79	1
81	0
83	1
84	1
87	1
191	0
196	0
220	0
254	0A
258	1
259	1A
260	2
262	1
271	2A
272	2
273	1A
274	1
279	1A
srovnávací prostředek A	5A
neošetřeno	5

Příklad 3

Účinek proti rzi *Puccinia recondita*

Listy pšenice druhu "Frühgold", které se pěstují v květináčích, se popráší spórami rzi *Puccinia recondita*. Potom se květináče umístí na dobu 24 hodin do vlhké komory, kde se udržuje teplota na 20 až 22°C a vysoká relativní vlhkost vzduchu (90 až 95%). Během této doby spóry vyklíčí a šlahouny klíčků pronikají do tkáně listu. Infikované rostliny se potom postříkají až do stadia odkapávání kapek vodnými postřikovými suspenzemi, které obsahují v sušině 80 % účinné látky a 20% emulgátoru. Po oschnutí postřikové vrstvy se pokusné rostliny umístí do skleníku, kde se udržují při teplotách mezi 20 a 22°C a při 65 až 70% relativní vlhkosti vzduchu. Po 8 dnech se zjistí stupeň vývoje rzi na listech.

Výsledky pokusu se hodnotí podle následující stupnice:

- 0 = žádné napadení houbou,
odstupňováno až do
- 5 = úplné napadení houbou
- A = mírné poškození listů,
- B = střední poškození listů,
- C = silné poškození listů a
- T = úplné poškození listů.

účinná
látka č.napadení listů po ošetření 0,025%
vodným přípravkem účinné látky

1	0A
2	0
8	2A
11	2A
14	2A
15	1
16	0A
20	2
21	0A
29	1
30	1
33	2
34	2
44	0A
47	1A
49	2
51	0
53	1
54	2
56	2A
74	2
79	1
81	2
83	1A
84	0A
87	1
191	2
196	0
204	0
220	2
254	1A
255	2
258	1
263	2
264	0A
271	1A
279	2A
282	2A
srovnávací prostředek A	3-4
neošetřeno	4-5

P ř í k l a d 4

Účinnost proti plísni šedé (*Botrytis cinerea*) na paprice

Rostliny druhu "Neusiedler Ideal Elite" se poté, když se dobře vyvine 4 až 5 listů, postříkají až do stadia odkapávání kapek vodnými suspenzemi, které obsahují v sušině 50 %

účinné látky a 20% emulgátoru. Po oschnutí postřikové vrstvy se rostliny postřikají suspenzí konidií houby plísně šedé (*Botrytis cinerea*) a potom se udržují při teplotě 22 až 24°C v místnosti s vysokou relativní vlhkostí vzduchu. Po 5 dnech se choroba na neošetřených kontrolních rostlinách vyvine tak silně, že vzniklé nekrosy listů pokrývají převážnou část povrchu listů.

Výsledky pokusu se hodnotí podle následující stupnice:

- 0 = žádné napadení houbou,
odstupňováno až do
5 = úplné napadení houbou.

účinná látko č.	napadení listů po ošetření 0,05% přípravkem účinné látky
1	1
19	1
44	2
47	2
54	1
73	1
79	2
81	2
83	0
87	2
191	1
196	1
204	2
222	1
254	1
256	1
257	2
261	2
262	2
263	2
267	1
270	2
272	2
275	2
284	2
285	2
286	2
srovnávací prostředek A	5
neošetřeno	5

P ř í k l a d 5

Účinnost proti braničnatce plevelové (*Septoria nodorum*)

Listy klíčnicích rostlin pšenice druhu "Jubilar", které se pěstují v květináčích, se až do stádia odkapávání kapek postříkají vodnou postřikovou suspenzí, které obsahuje v sušině 80% účinné látky a 20% emulgátoru. Následujícího dne se oschlé rostliny infikují vodnou suspenzí spór braničnatky plevelové (*Septoria nodorum*) a potom se dále kultivují 7 dnů při teplotě 17 až 19°C a při 95% relativní vlhkosti vzduchu. Potom se vizuálně zjistí stupeň napadení houbou.

Výsledky pokusu se hodnotí podle následující stupnice:

- 0 = žádné napadení houbou,
odstupňováno až do
- 5 = úplné napadení houbou;
- A = mírné poškození listů,
- B = střední poškození listů,
- C = silné poškození listů a
- T = úplné poškození listů.

účinná	napadení listů po ošetření
látka č.	0,05% přípravkem účinné látky

1	0
2	2
10	1
15	2
20	2A
29	2A
34	1A
39	2A
61	2
73	1
srovnávací	
prostředek A	3-4
neošetřeno	4

P ř í k l a d 6

Účinnost proti houbám *Paecilomyces variotii*, *Aureobasidium pullulans* a *Geotrichum candidans*

Za účelem testování účinnosti proti shora uvedeným houbám se účinné látky přidávají do živného roztoku, který je optimálně vhodný pro růst hub *Paecilomyces variotii*, *Aureobasidium pullulans* a *Geotrichum candidans* v množství 100, 50, 25, 12, 6, 3 a 1,5 dílu hmotnostních na milion dílů živného roztoku. Vždy 10 ml směsi živného roztoku a účinné látky se přenesou do sterilních zkumavek, které se naočkují kapkou suspenze spór, která obsahuje 10^6 konidií popřípadě buněk. Po 120 hodinové kultivaci se z těchto zkumavek, které nevykazují žádný patrný růst houby, odeberou vzorky a přenesou se na živné půdy pro houby. V následující tabulce se uvádí stupeň zředění, při kterém po přenesení vzorku na živné půdy již nedošlo k žádnému růstu houby.

T a b u l k a

množství účinné látky v ... ppm, které je fungicidně účinné

účinná látky	Paecilomyces variotii	Aureobasidium pullulans	Geotrichum candidans
1	--	6	6
2	12	6	12
29	3	3	3
39	6	1	1

P ř í k l a d 7

Účinnost proti houbám *Trichophyton mentagrophytes* a *Candida albicans*

Za účelem testování účinnosti proti shora uvedeným houbám se účinné látky přidávají do živného roztoku, který je optimálně vhodný pro růst hub *Trichophyton mentagrophytes* a *Candida albicans* v množství 100, 50, 25, 12, 6, 3 a 1,5 dílu hmotnostních na milion dílů živného roztoku. Vždy 10 ml směsi živného roztoku a účinné látky se přenesou do sterilních zkumavek, které se naočkují kapkou suspenze spór, která obsahuje 10^6 konidií popřípadě buněk. Po 120 hodinové kultivaci se z těchto zkumavek, které nevykazují žádný patrný růst houby, odeberou vzorky a přenesou se na živné půdy pro houby. V následující tabulce se uvádí stupeň zředění, při kterém po přenesení vzorku na živné půdy již nedošlo k žádnému růstu houby.

T a b u l k a

množství účinné látky v ... ppm, které je fungicidně účinné

účinná látky	<i>Trichophyton</i> <i>mentagrophytes</i>	<i>Candida</i> <i>albicans</i>
1	25	6
2	12	25
29	6	3
39	1,5	12

Nové sloučeniny se vyznačují, obecně vyjádřeno, vynikající účinností proti širokému spektru fytopathogenních hub, zejména ze třídy Ascomycetes a Basidiomycetes. Tyto sloučeniny jsou zčásti účinné systemicky a mohou se používat jako listové a půdní fungicidy.

Zvláště zajímavé jsou fungicidně účinné sloučeniny při potírání celé řady hub na různých kulturních rostlinách nebo jejich semenech, zejména na pšenici, žitě, ječmeni, ovsu, rýži, kukuřici, travách, bavlníku, sóji, kávovníku, cukrové třtině, ovocných stromech a okrasných rostlinách v zahradnictví, vinohradnictví, jakož i na zelenině, jako jsou okurky, fazole a tykvovité rostliny.

Fungicidní prostředek podle vynálezu je zvláště vhodný k potírání následujících chorob rostlin:

padlí travní (*Erysiphe graminis*) na obilovinách, padlí (*Erysiphe cichoracearum*) a *Sphaerotheca fuliginea* na tykvovitých rostlinách,
padlí jabloně (*Podosphaera leucotricha*) na jabloních,
padlí révy (*Uncinula necator*) na vinné révě,
různé druhy *Puccinia* na obilovinách,
různé druhy *Rhizoctonia* na bavlníku,
různé druhy sněti (*Ustilago*) na obilovinách a cukrové třtině,
strupovitost jabloní (*Venturia inaequalis*) na jabloních,
braničnatka plevelová (*Septoria nodorum*) na pšenici,
plíseň šedá (*Botrytis cinerea*) na jahodnicích, vinné révě,
Cercospora arachidicola na podzemnici olejné,
Pseudocercospora herpotrichoides na pšenici a ječmeni,
Pyricularia oryzae na rýži,
plíseň bramborová (*Phytophthora infestans*) na bramborách a rajských jablíčkách,
peronospora révy vinné (*Plasmopara viticola*) na vinné révě, jakož i různé druhy *Fusarium* a *Verticillium* na různých rostlinách.

Sloučeniny podle vynálezu se aplikují tím, že se rostliny postříkají nebo popráší účinnými látkami nebo se semena rostlin ošetří účinnými látkami. Aplikace účinných látek se provádí před nebo po infekci rostlin nebo semen houbou.

Nové látky se mohou převádět na obvyklé přípravky, jako jsou roztoky, emulze, suspenze, popraše, prášky, pasty a granuláty. Aplikací formy se zcela řídí účely použití. V každém případě mají zajistit jemné a rovnoměrné rozptýlení účinné látky. Tyto prostředky se vyrábějí známým způsobem, například smísením účinné látky s rozpouštědly nebo/a nosnými látkami, popřípadě za použití emulgátorů a dispergátorů, přičemž v případě použití vody jako ředidla se mohou používat také další organické rozpouštědla jako pomocná rozpouštědla. Jako pomocná rozpouštědla přicházejí pro tyto účely v podstatě v úvahu: rozpouštědla jako aromáty (například xylol), chlorované aromáty (například chlorbenzeny), parafinické uhleводíky (například ropné frakce), alkoholy (například methanol, butanol), ketony (například cyklohexanon), aminy (například ethanolamin, dimethylferamid) a voda; nosné látky, jako přírodní kamenné moučky (například kaolín, jíly, mastek, křída) a syntetické kamenné moučky (například vysoce disperzní kyselina křemičitá, křemičitany); emulgátory, jako mezenogenní a anionické emulgátory (například polyoxyethylenethery mastných alkoholů, alkylsulfonáty a arylsulfonáty) a dispergátory, jako lidain, sulfátové odpadní louhy a methylcelulóza.

Fungicidní prostředky obsahují obecně mezi X 0,1 a 95 % hmotnostními účinné látky, výhodně mezi 0,5 a 90 % hmotnostními účinné látky.

Aplikované množství se pohybuje vždy podle druhu požadovaného efektu mezi 0,02 a 3 kg účinné látky nebo více na 1 ha. Nové sloučeniny se mohou používat také při ochraně materiálů, například proti houbě *Paecilomyces variatii*. Aplikace účinných látek při ochraně materiálu se může uskutečňovat kromě jiného za účelem potírání dřevokazných hub, jako *Coniophora puteana* a *Polystictus versicolor*. Nové účinné látky se mohou používat také jako fungicidně účinné složky olejových prostředků k ochraně dřeva a to za účelem ochrany dřeva před houbami, které způsobují zbarvení dřeva, jako *Aureobasidium pullulans*. Aplikace se provádí tím způsobem, že se dřevo těmito prostředky ošetřuje, například impregnuje nebo natírá.

Prostředky, popřípadě z nich vyrobené přímo použitelné přípravky, jako jsou roztoky, emulze, suspenze, prášky, pasty, popraše nebo granuláty, se používají známým způsobem, například rozstříkáváním, zamlžováním, poprašováním, posypem, mořením nebo zaléváním.

Příklady ilustrující složení a přípravu prostředků

P ř í k l a d I

90 dílů hmotnostních sloučeniny č. 1 se smísí s 10 díly hmotnostními N-methyl- α -pyrrolidenu a získá se roztok, který je vhodný k aplikaci ve formě minimálních kapek.

P ř í k l a d II

20 dílů hmotnostních sloučeniny č. 2 se rozpustí ve směsi, která sestává z 80 dílů hmotnostních xylenu, 10 dílů adičního produktu 8 až 10 mol ethylenoxidu na 1 mol N-moethanolamidu olejové kyseliny, 5 dílů hmotnostních vápenaté soli dedecylbenzensulfonové kyseliny a 5 dílů hmotnostních adičního produktu 40 mol ethylenoxidu na 1 díl ricinového oleje. Vylitím a jemným rozptýlením roztoku ve vodě se získá vodná disperze.

P ř í k l a d III

20 dílů hmotnostních sloučeniny č. 15 se rozpustí ve směsi, která sestává ze 40 dílů hmotnostních cyklohexanenu, 30 dílů hmotnostních isobutanolu, 20 dílů hmotnostních adičního produktu 40 mol ethylenoxidu na 1 mol ricinového oleje. Vylitím a jemným rozptýlením roztoku ve vodě se získá vodná disperze.

P ř í k l a d IV

20 dílů hmotnostních sloučeniny č. 16 se rozpustí ve směsi, která sestává z 25 dílů hmotnostních cyklohexanenu, 65% dílů hmotnostních frakce minerálního oleje o teplotě varu 210 až 280°C a 10 dílů hmotnostních adičního produktu 40 mol ethylenoxidu na 1 mol ricinového oleje. Vylitím a jemným rozptýlením roztoku ve vodě se získá vodná disperze.

P ř í k l a d V

80 dílů hmotnostních sloučeniny č. 16 se dobře smísí se 3 díly hmotnostními sodné soli diisobutylnaftalen- α -sulfonové kyseliny, 10 díly hmotnostními sodné soli lignin-sulfonové kyseliny ze sulfitevého odpadního louhu a 7 díly hmotnostních práškového gelu kyseliny křemičité a směs se rozměluje v kladivovém mlýnu. Jemným dispergováním této směsi ve vodě se získá pestříková suspenze.

P ř í k l a d VI

3 díly hmotnostní sloučeniny č. 30 se důkladně smísí s 97 díly hmotnostními jemně dispergovaného kaolinu. Tímto způsobem se získá popraš, která obsahuje 3% hmotnostní účinné látky.

P ř í k l a d VII

30 dílů hmotnostních sloučeniny č. 28 se důkladně smísí se směsí 92 dílů hmotnostních práškového gelu kyseliny křemičité a 8 díly hmotnostními parafinového oleje, který byl nastříkán na povrch tohoto gelu kyseliny křemičité. Tímto způsobem se získá účinný přípravek s dobrou adhezí.

P ř í k l a d VIII

40 dílů hmotnostních sloučeniny č. 44 se důkladně smísí s 10 díly hmotnostními sodné soli kondenzačního produktu fenolsulfonové kyseliny, močoviny a formaldehydu, 2 díly hmotnostními silikagelu a 48 díly hmotnostními vody. Získá se stabilní vodná disperze. Zředěním vodou se získají vodné disperze požadované nižší koncentrace.

P ř í k l a d IX

20 dílů hmotnostních sloučeniny č. 47 se důkladně smísí se 2 díly hmotnostními vápenaté soli dodecylbenzensulfonové kyseliny, 8 díly hmotnostními polyglykoletheru mastného alkoholu, 2 díly hmotnostními sodné soli kondenzačního produktu fenolsulfonové kyseliny, močoviny a formaldehydu a 68 díly hmotnostními parafinického minerálního oleje. Získá se stabilní olejová disperze.

Prostředky podle vynálezu mohou být v těchto aplikačních formách přítomny také společně s dalšími látkami, jako například s herbicidy, insekticidy, regulátory růstu a fungicidy nebo také s hnojivy a společně se také aplikují. Při smísení s fungicidy se přitom v mnoha případech často dosáhne zvýšení spektra fungicidních účinků.

Následující seznam fungicidů, se kterými se mohou kombinovat sloučeniny podle vynálezu, má objasňovat možnosti těchto kombinací, jejich rozsah však není tímto výčtem omezen.

Fungicidy, které se mohou kombinovat se sloučeninami podle vynálezu jsou představovány například následujícími sloučeninami:

síra,
dithiokarbamáty a jejich deriváty, jako
dimethyldithiokarbamát železitý,
dimethyldithiokarbamát zinečnatý,
ethylen-bis-dithiokarbamát zinečnatý,
ethylen-bis-dithiokarbamát manganatý,
ethylendiamin-bis-dithiokarbamát manganato-zinečnatý,
tetramethylthiuramdisulfidy,
amoniakální komplex N,N-ethylen-bis-dithiokarbamátu zinečnatého,
amoniakální komplex N,N'-propylen-bis-dithiokarbamátu zinečnatého,
N,N-propylen-bis-dithiokarbamát zinečnatý,
N,N'-polypropylen-bis-(thiokarbamoyl)disulfid,

nitroderiváty, jako
dinitro-(1-methylheptyl)fenylkretonát,
2-sek.butyl-4,6-dinitrofenyl-3,3-dimethylakrylát,
2-sek. butyl-4,6-dinitrofenylisopropylkarbonát,
diisopropylester 5-nitroisofthalové kyseliny,

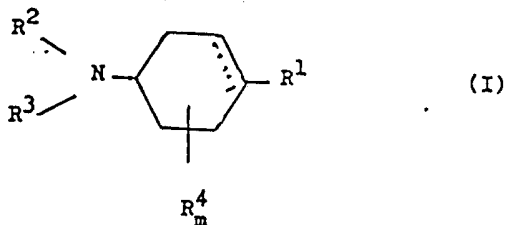
heterocyklické sloučeniny, jako
2-heptadecyl-2-imidazolinacetát,
2,4-dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin,
0,0-diethylftalimidofosfonothioát,
5-amino-1[bis(dimethylamino)fosforyl]-3-fenyl-1,2,4-triazol,
2,3-dikyan-1,4-dithionatrachinon,
2-thio-1,3-dithio [4,5-b] chinoxalin,
methylester 1-(butylkarbamoyl)-2-benzimidazolkarbamové kyseliny,
2-methoxykarbonylamino-benzimidazol,
2-(fur-2-yl)benzimidazol,
2-(thiazol-4-yl)benzimidazol,

N-(1,1,2,2-tetrachlorethylthio)tetrahydroftalimid,
 N-trichlormethylthiotetrahydroftalimid,
 N-trichlormethylthioftalimid,
 N-dichlorfluormethylthio-N', N'-dimethyl-N-fenyl-diamid kyseliny sírové,
 5-ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol,
 2-rhodanmethylthiobenzthiazol,
 1,4-dichlor-2,5-dimethoxybenzen,
 4-(2-chlorfenylhydrazon)-3-methyl-5-isoxazolona,
 pyridin-2-thio-1-oxid,
 8-hydroxychinolin, popřípadě jeho sůl s mědí,
 2,3-dihydro-5-karboxanilid-6-methyl-1,4-oxathiin,
 2,3-dihydro-5-karboxanilid-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-di oxid,
 2-methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-karboxanilid,
 2-methylfuran-3-karboxanilid,
 2,5-dimethylfuran-3-karboxanilid,
 2,4,5-trimethylfuran-3-karboxanilid,
 2,5-dimethylfuran-3-karboxcyklohexylamid,
 N-cyklohexyl-N-methoxy-2,5-dimethylfuran-3-karboxamid,
 2-methylbenzanilid,
 2-jodbenzanilid,
 N-formyl-N-morfolin-2,2,2-trichlorethylacetát,
 piperazin-1,4-diyl-bis-[1-(2,2,2-trichlorethyl)]-formamid,
 1-(3,4-dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan,
 2,6-dimethyl-N-tridecylmorfolin, popřípadě jeho soli,
 2,6-dimethyl-N-cyklohexylmorfolin, popřípadě jeho soli,
 N-[3-(p-terc.butylfenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethylmorfolin,
 N-[3-(p-terc.butylfenyl)-2-methylpropyl] piperidin,
 1-[2-(2,4-dichlorfenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol,
 1-[2-(2,4-dichlorfenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-ylethyl]-1H-1,2,4-triazol,
 N-(n-propyl)-N-(2,4,6-trichlorfenoxyethyl)-N-imidazol-ylmochovina,
 1-(4-chlorfenoxi)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon,
 1-(4-chlorfenoxi)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol,
 4-(2-chlorfenyl)-4-(4-chlorfenyl)-5-pyrimidin-methanol,
 5-butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin,
 bis-(p-chlorfenyl)-3-pyridinmethanol,
 1,2-bis-(3-ethoxykarbonyl-2-thioureido)benzen,
 1,2-bis-(3-methoxykarbonyl-2-thioureido)benzen,
 jakož i různé fungicidy, jako
 dodecylguanidinacetát,
 3-[3-(3,5-dimethyl-2-oxocyklohexyl)-2-hydroxyethyl] glutarimid,
 hexachlorbenzen,
 DL-methyl-N-(2,6-dimethylfenyl)-N-fur-2-oyl-alaninát,
 methylester DL-N-(2,6-dimethylfenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)alaninu,
 N-(2,6-dimethylfenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolakton,
 methylester DL-N-(2,6-dimethylfenyl)-N-(fenylacetyl)alaninu,
 5-methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorfenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin,
 3-[3,5-dichlorfenyl-(5-methyl-5-methoxymethyl)]-1,3-oxazolidin-2,4-dion,
 3-(3,5-dichlorfenyl)-1-isopropylkarbamoylhydantoin,
 N-(3,5-dichlorfenyl)-1,2-dimethylcyklopropan-1,2-dikarboximid,

2-kyan-[N-(ethylaminokarbonyl)-2-methoximin] acetamid,
 1-[2-(2,4-dichlorfenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazol,
 2,4-difluor- α -(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)benzhydryls alkohol,
 N-(3-chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethylfenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin a
 1-[(bis-(4-fluorfenyl)methylsilyl)methyl]-1H-1,2,4-triazol.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Fungicidní prostředek, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jeden 4-substituovaný derivát cyklohexylaminu obecného vzorce I



ve kterém

R^1 znamená skupinu $CR^5R^6R^7$, kde R^5 , R^6 a R^7 jsou stejné nebo rozdílné a znamenají vodík, rozvětvenou nebo nerozvětvenou, popřípadě hydroxyskupinu substituovanou alkylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylthioskupinou s 1 až 6 atomy uhlíku, nebo cykloslkylovou skupinou se 3 až 6 atomy uhlíku s tím, že nejvýše jeden ze substituentů R^5 , R^6 nebo R^7 smí znamenat vodík, nebo R^5 má některý ze shora uvedených významů a R^6 a R^7 společně s atomem uhlíku, který je mezi nimi tvoří tří- až šestičlenný karbocyklický alifatický kruh,

R^2 a R^3 jsou stejné nebo rozdílné a znamenají atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 20 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku nebo alkylovou skupinu se 3 až 4 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu se 3 až 12 atomy uhlíku nebo cykloalkenylovou skupinu s 5 až 8 atomy uhlíku, které mohou být samy opět substituovány hydroxyskupinou, alkylskupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, alkylthioskupinou s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, alkenylovou skupinou se 2 až 4 atomy uhlíku, alkinylovou skupinou se 3 až 4 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinou se 3 až 12 atomy uhlíku nebo fenýlovou skupinou, naftýlovou skupinou, fenoxyskupinou nebo naftoxyskupinou, které samy mohou být popřípadě substituovány alkylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, alkenylovou skupinou se 2 až 4 atomy uhlíku, alkinylovou skupinou se

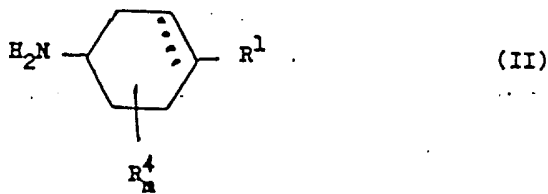
3 až 4 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinou se 3 až 6 atomy uhlíku nebo cykloalkenylovou skupinou s 5 až 8 atomy uhlíku, alkoxykupinou se 2 až 8 atomy uhlíku, atomem halogenu nebo trifluormethylovou skupinou s tím, že součet atomů uhlíku a heteroatomů, tj. atomu kyslíku, atomu síry, halogenu, v substituentech R^2 a R^3 činí společně alespoň 8,

R^4 znamená stejné nebo rozdílné substituenty zvolené ze skupiny, která je tvořena atomem vodíku, alkylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinou se 3 až 8 atomy uhlíku nebo alkoxykupinou s 1 až 8 atomy uhlíku,

n znamená číslo 1 až 4 a

..... znamená jednoduchou nebo dvojnou vazbu, nebo sůl takové sloučeniny a pevný nebo kapalný nosič.

2. Způsob výroby účinných látek podle bodu 1, obecného vzorce I, vyznačující se tím, že se odpovídající primární aminy obecného vzorce II



ve kterém

R^1 , R^4 , n , mají shora uvedené významy, alkylují působením alkylačních činidel zavádějících zbytky R^2 a R^3 shora uvedeného významu.